

(19) Organización Mundial de la Propiedad
Intelectual
Oficina internacional



(43) Fecha de publicación internacional
22 de Septiembre de 2005 (22.09.2005)

PCT

(10) Número de Publicación Internacional
WO 2005/087795 A1

(51) Clasificación Internacional de Patentes⁷: C07K 7/06,
7/08, A61K 38/08, 38/10, 47/42

(74) Mandatario: SEGURA CÁMARA, Pascual; Centro de
Patentes de la UB, Baldiri Reixac, 4, E-08028 Barcelona
(ES).

(21) Número de la solicitud internacional:
PCT/ES2005/000116

(81) Estados designados (*a menos que se indique otra cosa,
para toda clase de protección nacional admisible*): AB,
AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY,
BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ,
EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID,
IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT,
LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI,
NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,
SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(22) Fecha de presentación internacional:
7 de Marzo de 2005 (07.03.2005)

(25) Idioma de presentación: español

(26) Idioma de publicación: español

(30) Datos relativos a la prioridad:
P200400653 8 de Marzo de 2004 (08.03.2004) ES

(84) Estados designados (*a menos que se indique otra cosa,
para toda clase de protección regional admisible*): ARIPO
(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ,
UG, ZM, ZW), euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD,
RU, TJ, TM), europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,
PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Solicitante (*para todos los Estados designados salvo US*):
UNIVERSIDAD DE BARCELONA [ES/ES]; Centro de
Patentes de la UB, Baldiri Reixac, 4, E-08028 Barcelona
(ES).

(72) Inventores; e

(75) Inventores/Solicitantes (*para US solamente*): GIRALT
LLEDÓ, Ernest [ES/ES]; Centro de Patentes de la UB,
Baldiri Reixac, 4, E-08028 Barcelona (ES). FERNÁNDEZ
CARNEADO, Jimena [ES/ES]; Centro de Patentes de la
UB, Baldiri Reixac, 4, E-08028 Barcelona (ES).

Publicada:

— con informe de búsqueda internacional

*Para códigos de dos letras y otras abreviaturas, véase la sección
"Guidance Notes on Codes and Abbreviations" que aparece al
principio de cada número regular de la Gaceta del PCT.*

(54) Title: USE OF PEPTIDES AS PENETRATING CELL CARRIERS

(54) Título: PÉPTIDOS COMO PORTADORES PENETRANTES DE CÉLULAS

(57) Abstract: The invention relates to compounds having formula (I) or the biologically- or pharmaceutically-acceptable salts thereof which are used as penetrating cell carriers. According to formula (I), Val is L-Val or D-Val; Arg is L-Arg, D-Arg or L-(N-methyl)Arg; Pro is L-Pro or D-Pro; Leu is L-Leu or D-Leu; x is an integer of between 1 and 20, preferably 3; L₁ and L₂ are chemical linkers; M₁ and M₂ are pharmaceutically- and/or biologically-active groups; and the linkage between L₁ and M₁ and the linkage between L₂ and M₂ are of any known chemical nature, including covalent and ionic. Compared to other previously-described carrier peptides, said novel family offers many advantages including its non-viral origin, amphipathic character, water solubility and the absence of a cytotoxic effect at high concentrations. M₁-L₁-(Val-Arg-Leu-Pro-Pro-Pro)_x-L₂-M₂ (I)

(57) Resumen: Los compuestos de fórmula (I) o sus sales farmacéutica o biológicamente aceptables son útiles como portadores penetrantes de células. Según la fórmula (I), Val es L-Val o D-Val; Arg es L-Arg, D-Arg o L-(N-metil)Arg; Pro es L-Pro o D-Pro; Leu es L-Leu o D-Leu; x es un entero del 1 al 20, preferiblemente 3; L₁ y L₂ son conectores químicos; M₁ y M₂ son grupos farmacéutica y/o biológicamente activos; y el enlace entre L₁ y M₁ y el enlace entre L₂ y M₂ son de cualquiera de las naturalezas químicas conocidas, incluyendo covalente e iónica. Comparados con otros péptidos portadores descritos previamente, esta nueva familia presenta muchas ventajas, incluyendo su origen no viral, su carácter anfipático, su solubilidad en agua y la ausencia de un efecto citotóxico a concentraciones elevadas. M₁-L₁-(Val-Arg-Leu-Pro-Pro-Pro)_x-L₂-M₂ (I)

WO 2005/087795 A1